

2021 年 3 月 26 日

学 位 論 文 の 内 容 の 要 約

氏 名	細谷 圭介
学位の種類	博士（工学）
学府又は研究科・専攻	大学院工学府 生命工学専攻
指導を受けた大学	東京農工大学
学位論文題目	酸化的環化反応及び位置選択的 aza-Michael 反応による 4 環性ヒドロカルバゾール誘導体の合成法の開発とモノテルペンインドールアルカロイド類の合成への応用

【論文の内容の要約】

モノテルペンインドールアルカロイド (MIA) は、主に植物から単離されるアルカロイドの一群であり、多様な生理活性を有していることから創薬シード化合物として重要な化合物群である。本研究では、モノテルペンインドールアルカロイド (MIA) 類の網羅的合成を志向した、ジアリールアミン類の酸化的環化反応及び位置選択的 aza-Michael 反応を基盤とした 4 環性ヒドロカルバゾール誘導体の新規合成法の開発と、当該反応の MIA 類の合成への応用について検討を行った。

第 1 章では、MIA 類の部分構造として見出される 4 環性ヒドロカルバゾール構造の構築に関するこれまでの報告例についてまとめた。

第 2 章では、超原子価ヨウ素試薬を用いたジアリールアミン誘導体の酸化的脱芳香族的環化反応と、生じたジェノンの位置選択的な分子内 aza-Michael 反応について検討をおこなった。その結果、アミン部位の保護基としてメトキシカルボニル基を有する種々のジアリールアミンを基質とすることで、対応するジェノンが中程度から高い収率で得られることを見出した。また、分子内 aza-Michael 反応においては、作用させる酸の種類によって位置選択性が変化することを見出した。

第 3 章では、第 2 章で開発した超原子価ヨウ素試薬を用いたジアリールアミン誘導体の酸化的脱芳香族的環化反応及び位置選択的な分子内 aza-Michael 反応を基盤とし、*Aspidosperma* 型アルカロイドの一種である 10-methoxyaspidospermidine の合成について検討を行った。その結果、第 2 章で開発した手法を適用することで得られる 4 環性エノンに対し、アルドール縮合による α,β -不飽和エステル部位の導入と、ラジカル 6-*exo-trig* 環化を行うことで、10-methoxyaspidospermidine の全ての炭素骨格を有するケトエステルが収率 90%で得られることを見出した。

第 4 章では、本論文を総括し、その意義を示した。